

常用进口药物手册

主编 由品英

A Handbook
of Imported
Drugs

M

2

ost in Use

常用进口药物手册

(2)

主 编	由品英		
副主编	尹永祥	陈盛新	魏水易
	刘吉祥	扈本山	
审 校	金 进		

天津科技翻译出版公司

责任编辑:万家祯 许钟秀

常用进口药物手册(2)

主 编:由品英

副主编:尹永祥 陈盛新 魏水易

刘吉祥 扈本山

* * *

天津科技翻译出版公司出版

(邮政编码:300192)

新华书店天津发行所发行

南开大学印刷厂印刷

* * *

开本 850×1168 1/32 印张:19.5 字数:486 千字

1995 年 10 月第 1 版 1995 年 10 月第 1 次印刷

印数:1~4000 册

ISBN7-5433-0818-5

R·233 定价:34.00 元

编译人员名单

主 编	由品英		
副主 编	尹永祥	陈盛新	魏水易
	刘吉祥	扈本山	
审 校	金 进		
编 译	(按姓氏笔划顺序排列)		
	一 江	尹永祥	王国权
	由品英	叶惠珍	刘吉祥
	史俊义	朱全刚	汤 真
	吴 伟	何志高	何纯祥
	宋耕福	陈征宇	陈盛新
	李 伟	李医明	张信红
	武建国	苗 红	项 阳
	郑 荣	扈本山	郭震洲
	董亲颐	韩守智	廖耀中
	薛秉文	魏水易	
责任编辑	万家祯	许钟秀	
封面设计	杜永怡		

出版者的话

我公司于 1993 年 3 月出版了由中国人民解放军医药信息研究所、全军药学情报中心和第二军医大学的专家、教授们编译的《常用进口药物手册》，其中收编了截止到 1991 年的 222 种常用进口药物。此书出版发行后，受到全国各地医药界的欢迎。

鉴于世界各发达国家的医药工业发展迅速，每年都有许多新药上市，如果按原计划采用增订方式补加新内容会使此书变得很厚而不便阅读。所以，为使我国的药物情报咨询工作能与世界医药事业的发展同步，我公司已和中国人民解放军医药信息研究所和全军药学情报中心商定，将此书变为系列丛书，每两年出版一本，分别介绍较近两年的国外上市新药，每本书的书名保持不变，但从第二本开始，在书名后加上序号。例如，今日出版的第二本，介绍 1992~1993 两年中的国外上市新药，定名为《常用进口药物手册(2)》；预定于 1997 年出版的第 3 本则介绍 1994~1995 两年中的国外上市新药，定名为《常用进口药物手册(3)》；其余以此类推。

天津科技翻译出版公司

1995. 9.

编写说明

- 一、本书是常用进口药物系列丛书的第 2 本,收编了 1992~1993 两年期间的大部分国外上市新药,计 146 种。在此期间的少数上市新药因资料收集不全而未收编入内,我们将继续收集,力争补加到下一册中。个别药(蒿甲醚)虽属我国研制生产,但为世界上承认的上市新药,故也收编在内。
- 二、本书作为一册独立的专集奉献给读者。因此,书末的中、英文药名索引只限于本书收录的药物。
- 三、本书目录仍沿用原《新药情报》资料的分类,因此排列顺序有缺项。
- 四、每种药品下,我们尽可能齐全地收载了药物的不同名称、化学结构、药理作用、药代动力学、适应症、剂量与用法、临床评价、不良反应、注意事项、制剂规格、生产厂家、进口许可证号等资料,以满足药师、医师及产、供、销单位医药技术人员的参考需要。
- 五、本书中的“进口许可证号”由于有的药物尚未进口,有的未能查到,只好空缺,请读者补填。
- 六、编写时曾参考、引用了国内、外一些文献资料和书籍,由于篇幅所限,未能一一列出,谨向原作者和出版单位致谢。
- 七、本书虽请有关专家审阅,但由于编者水平所限,疏漏、欠妥之处在所难免,热切期望读者批评指正。

编者

1995. 7.

目 录

目 录

一、抗微生物药物

1. 青霉素类

氧哌嗪青霉素钠/他唑巴
坦 1

2. 头孢菌素类

头孢泊姆 5

头孢他美新戊酰氧甲
酯 9

● 头孢克肟 12

‘ 头孢米诺 16

头孢匹罗 21

✓ 头孢泊肟 27

头孢齐尔 30

头孢丙烯 33

头霉素拉坦 39

— 罗拉碳头孢 44

5. 大环内酯类

阿齐红霉素 48

克拉霉素 56

地红霉素 59

罗红霉素 63

6. 其它合成抗菌药物

依诺沙星 66

氟罗沙星 69

洛美沙星 76

那的沙星 80

培氟沙星 85

卢氟沙星 89

司巴沙星 92

7. 抗结核菌药物

利福布丁 100

8. 抗真菌药物

伊曲康唑 103

萘特康唑 106

舍他康唑 111

9. 抗病毒药物

佛斯卡耐特 114

盐酸金刚乙胺 118

索利伏汀 121

扎西他宾 126

10. 抗原虫药物

蒿甲醚 131

美普龙 136

二、作用于神经系统药物

1. 镇痛药/戒毒剂

阿法美沙醇 139

2. 解热、消炎镇痛药

乙酰氯芬酸 144

阿扎丙宗 147

氟比洛芬乙酰氧基乙
酯 150

消炎痛法呢酯 154

痛风利仙 157

苯噻丙酸 160

目 录

扎托布洛芬	163
3. 抗震颤麻痹药物	
帕金宁控释片	169
4. 抗精神失常药	
氯氮平	175
洛沙平	179
吗氯贝胺	184
瑞莫必利	188
瑞司派酮	191
盐酸舍曲林	197
5. 抗癫痫药物	
苯丙氨酯	199
加巴喷丁	203
奥卡西平	206
6. 镇静、催眠、解痉药	
脊舒	211
左吡登	214
7. 全身麻醉药	
去氟烷	218
异丙酚	227
8. 骨骼肌松弛剂	
氯化米哇库铵	232
10. 拟胆碱药物	
他克林	235
11. 催醒药物	
氟马唑尼	238
12. 促神经生长药物	
康络素	241

三、作用于循环系统药物

1. 强心药物	
氟西嗪南	244
米力农乳酸盐	247
2. 抗心律失常药物	
索他洛尔	250
3. 抗心绞痛药	
单硝酸异山梨糖醇 ...	254
4. 周围血管扩张药物	
苧雷前列	257
5. 降血压药物	
氯氯地平	261
巴尼地平	264
贝那普利	268
富马酸比索洛尔	273
地拉普利	276
盐酸伊米普利	279
尼索地平	282
派噪普利	289
喹那普利	296
特拉唑嗪	301
多沙唑嗪	305
替利索洛尔	307
泉多普利	311
6. 降血脂药	
斯伐他丁	315

四、作用于呼吸系统药物

1. 祛痰药物	
---------	--

目 录

替美斯丁	319	抑肽酶	392
2. 平喘药物		干燥浓缩人血凝固	
奈多罗米钠	322	第Ⅸ因子	402
五、作用于消化系统药物		重组抗血友病因子Ⅷ	407
1. 抗酸及治溃疡病药			
兰索拉唑	325	八、血容量扩充剂(血浆代用品)	
尼扎替丁	331	血脉素	413
2. 健胃消化药物		十一、抗变态反应药物	
西沙必利	335	依米司汀	416
3. 止泻药		氟雷他定	420
思密达	338	十二、激素及其有关药物	
六、作用于泌尿系统药物		脱氧炔诺酮/炔雌醇	423
膀胱灵	341	达英-35	426
芬甾酮	345	依帕司他	431
盐酸丙哌维林	348	缓退瘤	436
他索罗辛	353	格列喹酮	438
托拉塞米	358	组氨瑞林	442
七、作用于血液凝固系统药物		美可治	445
1. 抗凝血药物		茶法林	449
东菱精纯克栓酶	361	奥曲肽	455
达那帕罗	368	普拉睾酮	460
依诺肝素	372	生长抑素	466
伊洛前列素	373	十三、调节水、电解质及酸碱平衡药物	
组织培养原尿激酶	377	阿兰屈酯	470
沙泊格林	379	益钙宁	473
噻氯匹定	384		
托保地平	389		
2. 促凝血药物			

目 录

十六、抗肿瘤药物

胺苯吡啶..... 476

卡莫氟..... 480

克拉屈平..... 484

阿糖胞苷十八碳磷

酸酯钠..... 488

去甲氧柔红霉素..... 492

右丙亚胺..... 500

氟屈膦酸二钠..... 503

福美司坦..... 508

异环磷酰胺/巯乙磺

酸钠..... 511

醋酸亮丙瑞林..... 518

米特福辛..... 521

紫杉醇..... 524

喷司他丁..... 530

氯化锶-89 533

替尼泊甙..... 536

十七、免疫抑制剂

他克罗姆..... 541

十八、免疫增强剂

阿地流津(重组白

细胞介素-2) 549

甲肝疫苗..... 553

肝灵素片..... 555

重组干扰素 β -1b ... 558

重组 γ -干扰素 561

替西流津(重组白

细胞介素-2) 565

十九、眼科用药

诺朵睛酸..... 570

二十二、诊断用药物

瓦斯康(胃内窥镜

消泡剂) 573

二十三、营养药物

力保肪宁..... 576

二十四、脑代谢改善剂

茴拉西坦..... 580

甲胺乙吡啶..... 584

丁咯地尔..... 587

沙丙蝶呤..... 590

二十五、皮肤科用药

地泼罗酮丙酸酯..... 593

一、抗微生物药物

1. 青霉素类

氧哌嗪青霉素钠/他唑巴坦

Piperacillin Sodium/Tazobactam Sodium (Zosyn)

本品是一种新型 β 酰胺酶抑制剂 tazobactam 与已上市多年的氧哌嗪青霉素的复方制剂。

【化学名称】 Piperacillin sodium: 6-[[[(4-乙基-2,3-二氧-1-哌嗪基)羧基]氨基]苯乙酰基]氨基]-3,3-二甲基-7-氧-4-硫杂-1-氮杂双环[3,2,0]庚烷-2-羧酸钠盐

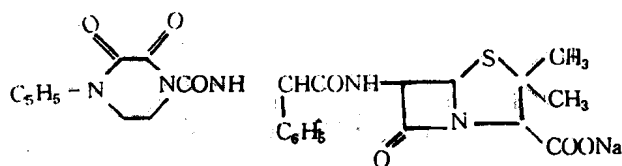
Sodium 6-[[[(4-ethyl-2,3-dioxo-1-piperazinyl) carbonyl] amino] phenylacetyl] amino]-3,3-dimethyl-7-oxo-4-thia-1-azabicyclo[3,2,0]heptane-2-carboxylate

Tazobactam sodium: 3-甲基-7-氧代-3-(1H-1,2,3-三唑-1-基甲基)-4-硫杂-1-氮杂双环[3,2,0]庚烷-2-羧酸 4,4-二氧化物

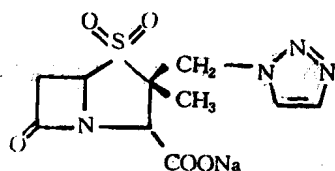
3-Methyl-7-oxo-3-(1H-1,2,3-triazol-1-ylmethyl)-4-thia-1-azabicyclo[3,2,0]heptane-2-carboxylic acid 4,4-dioxide

【化学结构】

Piperacillin sodium:



Pivobactam sodium



【性状】 为白色或类白色粉末，无臭。易溶于乙醇，不溶或几乎不溶于丙酮、氯仿与乙醚。

【药理作用】 本品是迄今上市的第4种与β-酰胺酶抑制剂组成的复方抗菌素，前3种已经上市的有阿莫西林(amoxicillin)，氨苄青霉素(ampicillin)和替卡西林(ticarcillin)。

细菌对β-酰胺类抗菌素最常见的耐药性是产生β-酰胺酶。β-酰胺酶抑制剂通过使微生物产生的β-酰胺酶失活，而保护和增强抗菌素的抗菌作用。

Tazobactam 是已在美国应用的第三种β-酰胺酶抑制剂，其它两种是棒酸钾和 sulbactam。本品能抑制大多数已确定的β-酰胺酶，比其它两种药物对β-酰胺酶具有更强和更广谱的抑制作用。Tazobactam 是青霉素核的衍生物，但是它有最小的固有的抗菌活性。当与 piperacillin 复合在一起时，Tazobactam 抑制β-酰胺酶，导致协同作用，扩大氧哌嗪青霉素的抗菌谱，即对单用氧哌嗪青霉素不敏感的某些细菌也有抑制作用。

氧哌嗪青霉素/他唑巴坦象第1代头孢菌素例如头孢唑啉(Ancef)那样对革兰氏阳性需氧菌有效,并象第三代头孢菌素例如菌必治(Rocephin)对革兰氏阴性菌有效。它对肠球菌的效力可与氨苄青霉素相比拟,它对厌氧菌的效能类似于甲硝唑(metronidazole)。

因为它具有广谱抗菌作用,因此,对怀疑有多种细菌感染患者可能有效。

在几个可以比较的临床试验中,对患有多种细菌感染的病人,本品已经显示具有等于或大于氯洁霉素(cleocin)加庆大霉素、复方亚胺霉素(imipenem/cilastatin)和替曼汀(Ticarcillin/potassium clavulanate)等药物的疗效。

【适应症】 适应于腹腔内、妇科、皮肤科和下呼吸道等的感染。它的适应症很类似于氨苄青霉素/舒巴坦(Unasyn)。本品还适用于军团获得性肺炎。然而,本品还在研究用于治疗更多的细菌感染如败血症,尿路感染和骨关节炎等。

比较本品同Piperacillin的作用,本品主要单独用于怀疑或确诊多种细菌混合感染,而Piperacillin(没有tazobactam)最常与氨基糖甙类联合应用于中性粒细胞减少症病人的感染或医院内感染的肺炎。

【剂量与用法】 本品是静脉给药,应缓慢滴注(30分钟以上)。本品有效的成人剂量每6小时是3.375g,7~10天为一个疗程。

【不良反应】 最常见的不良反应是胃肠道反应如腹泻(11%)、便秘(8%)、恶心(7%)、食欲减低(3%)、头痛(8%)、失眠(7%)、皮疹(4%)和瘙痒(3%)。局部反应如静脉炎(1%)是少见的。

【注意事项】 同Piperacillin或其它广谱青霉素。对任何青霉素,头孢菌素或 β -内酰胺酶抑制剂有过敏史的患者禁用本品。此外

还要注意可能的出血、低血钾和血钠过高。本品每克 Piperacillin 含有 54mg 钠, 小于替曼汀(每克 ticacillin 含 109.25mg)或氨苄青霉素/舒巴坦(每克含 115mg 钠)。

如同其它青霉素一样, 不应在本品的溶液中加入氨基糖甙类如庆大霉素, 因为可能会使氨基糖甙类失去活性。本品与妥布霉素一起治疗病人, 虽然也引起妥布霉素药代动力学数据的轻微变化, 但不需要调整剂量。

Piperacillin 已有报告可引起 Vicuronium 神经肌肉阻滞的延长。本品与 Piperacillin 作用相似, 使用非去极化肌肉松弛剂的患者应当注意。

【制剂规格】 每小瓶 2.25、3.375 或 4.5g, 其中含氧哌嗪青霉素钠分别相当于 2、3 和 4 克, 含他唑巴坦分别相当于 0.25、0.375 和 0.5 克。肾功能障碍的患者(血浆肌酸酐清除率 $\leq$ 40ml/min)应减量。

本品可用 5ml 适当的释稀剂如灭菌注射蒸馏水, 0.9% 氯化钠注射液或 5% 葡萄糖稀释。然而, 不能用乳酸林格氏溶液稀释。

【生产厂家】 美国 Lederle 公司

【进口许可证号】

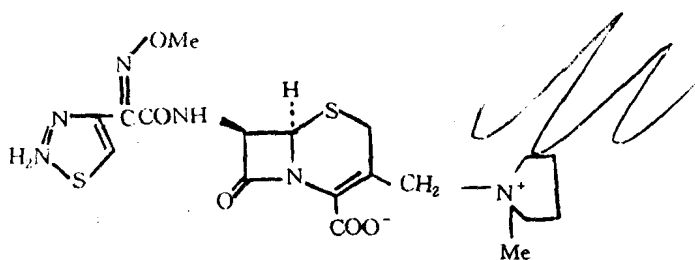
2. 头孢菌素类

头 孢 泊 姆

Cefepime (BMV28142,
My28142, Maxipime)

【化学名称】 7-[α -(2-氨基噻唑基-4)- α -Z-甲氧亚胺乙酰氨基(甲基吡咯烷基)甲基-3-头孢烯羧酸盐

【化学结构】



【药理作用】 本品是一种新型第四代头孢菌素。在其 3 位侧链上连接一个季铵 N-甲基-吡咯烷。在抗菌谱和对 β -内酰胺酶的稳定性方面,明显优于第三代头孢菌素。与第三代头孢菌素比较, Cefepime 的抗菌谱有了进一步扩大。例如头孢噻肟对肠杆菌属有很强的抗菌活性,对葡萄球菌也有较强抗菌性,但对绿脓杆菌的抗菌活性差。头孢噻甲羧肟(Ceftazidime)有强的抗绿脓杆菌活性,但对葡萄球菌的抗菌活性差。Cefepime 则对诸多 G⁺和 G⁻细菌包括肠杆菌属、绿脓杆菌和其他非发酵性 G⁻杆菌、嗜血杆菌、奈瑟氏球菌属、葡萄球菌、链球菌(除肠球菌外),均有较强的抗菌活性。

Fuchs 等对 37 种细菌的 750 株细菌的体外药敏试验表明。在这些细菌中,Cefepime 仅对肠球菌和耐甲氧西林的金葡萄菌的抗菌活性较差。Cefepime 对耐第三代头孢菌素的 G⁻杆菌仍显示出良好的抗菌活性。然而就 MICs 而言,虽然均在有效抑菌浓度的范围内,但在耐药菌则明显高于敏感菌。对某些第二、第三代头孢菌素产生耐药的机制主要与 2 个因素相关:①药物通过 G⁻细菌外膜的扩散程度缓慢;②药物对周质中的许多 β -内酰胺酶有高的亲合性。Cefepime 则由于透入到细胞内的速率极大地增加,导致了对酶的亲合性降低及水解速度减慢,因而对 β -内酰胺酶稳定。

【药代动力学】 Cefepime 可经静脉或肌肉注射,静脉注射时,通常要求在 30min 内以恒定的速率注入在健康志愿者中,单剂或多次静注 250~2000mg 的剂量后,一些主要的药代动力学参数表明了线性和剂量相关的药代动力学特征。本品清除半衰期为 2h 左右。稳态分布容积为 20L 左右,与剂量不相关。总体清除率为 130ml/min,肾清除率(主要肾小球滤过,从肾小管分泌甚微)约占其中 85%。药量的 85%以原形从尿中排出。

肌肉注射后,药物吸收迅速,且较完全。肌注剂量为 250~2000mg 的范围时,1~1.6h 后的血峰浓度为 8~60 μ g/ml,约为同等剂量静注后血峰浓度的 1/2。肌注后的清除半衰期为 2h 左右,与剂量不相关。其绝对生物利用度为 100%。

Cefepime 的蛋白结合率约为 14~19%,与血药浓度和时间无相关性。肌注 500~2000mg 后的 10~20h 内,本品的血药浓度对许多敏感菌可保持 MIC₉₀以上。药物吸收后,主要分布在细胞外液腔内。从炎性液体(皮肤脓疱)、腹水、胆汁、兰尾内、胆囊内、支气管粘液及尿液中均可检出有效药物浓度。药物也可进入母乳中,但药量甚微。已测得在健康哺乳的女性中,24h 内进入乳汁的药物累积量低于使用剂量的 0.01%。

无论多次静注或肌注(iv,q8h;im,q12h),连续 10 天,在健康

志愿者中未发现对本品的蓄积作用。但在老年患者或肝、肾功能不全者需调整剂量。在老年人中,平均清除半衰期可延迟到 3h 左右。在肾功能不全的患者中,如肾肌酐清除率 $<10\text{ml/min}$ 时,清除半衰期可达 13h 左右;若进行血液透析,则可使清除半衰期 $<2\text{h}$ 。有肝损害的患者,其药代动力学虽然类似于健康志愿者,但使用中仍应慎重。

【适应症】 G^+ 及 G^- 菌感染如金黄色葡萄球菌、链球菌及绿杆菌、克雷白氏菌、流感嗜血杆菌引起的肺炎,菌血症,败血症等。

【剂量与用法】 由于葡萄球菌、链球菌(除肠球菌外)、嗜流感杆菌、奈瑟氏球菌及肠杆菌属对 Cefepime 的 MIC 分别为 2mg/L 或更低;Cefepime 在静注(2000mg)后 8h,血浆和炎性渗出液中的浓度分别为 6.4mg/L ,因此,应用 Cefepime 2000mg 每天 2~3 次,足以达到对敏感菌的抗菌效果。对于重度感染主张联合应用 Cefepime 和一个氨基糖甙类抗生素,如静注 Cefepime(200mg)和丁胺卡那(300mg) $q8\text{h}$,共 4 次剂量,在用药期间未发现各个药物的药代动力学及其在尿中的排泄受到影响。

【临床评价】 Neu 报告,用 Cefepime 治疗老年性呼吸道感染的 112 例(平均年龄 62 岁)中,93%引起肺炎和 90%引起支气管炎的病原菌均被清除。从这 112 例分离的病原菌中。最多见的是肺炎链球菌、嗜流感杆菌、绿脓杆菌、金葡菌。Neu 认为,用 Cefepime $1\text{g},q12\text{h}$ 治疗中度严重的支气管炎和肺感染的疗效与用头孢噻甲羧肟 $1\text{g},q8\text{h}$ 的疗效相同。在一项随机对照研究中,应用 Cefepime $1\text{g},q12\text{h}$ 治疗 79 例,应用头孢噻甲羧肟 $1\text{g},q8\text{h}$ 治疗 35 例呼吸道感染病例,两组病情的严重程度相仿。结果显示,在支气管炎组:Cefepime 的临床治愈率为 93%,细菌清除率为 97%;头孢噻甲羧肟的临床治愈率为 93%,细菌清除率为 100%。在肺炎组:Cefepime 的临床治愈率为 82%,细菌清除率为 93%;头孢噻甲羧肟的临床治愈率为 85%,细菌清除率为 83%。在另一组应用